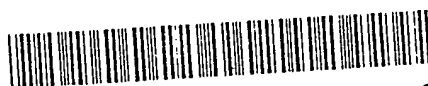


(19)



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets



0 394 553 B1

(1) Publication number:

(12)

## EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

(4) Date of publication of patent specification: 21.06.95 (5) Int. Cl.<sup>8</sup>: A61K 31/47, A61K 31/495, A61K 31/44

(2) Application number: 89120396.0

(22) Date of filing: 03.11.89

The file contains technical information submitted after the application was filed and not included in this specification

(54) Use of fluorine containing pyridone carboxylic acid derivatives for preparing a medicament for the treatment of HIV infections.

(3) Priority: 28.04.89 JP 110800/89  
24.07.89 JP 191062/89

(42) Date of publication of application:  
31.10.90 Bulletin 90/44

(43) Publication of the grant of the patent:  
21.06.95 Bulletin 95/25

(62) Designated Contracting States:  
AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI NL SE

(53) References cited:  
EP-A- 0 165 474  
WO-A-90/13542

J. GEN. VIROL., vol. 64, part 10, 1983, pages 2329-2333; Y. SUMIYOSHI et al.: "Inhibition of retrovirus RNA-dependent DNA polymerase by novoblocin and nalidixic acid"

INN. MED., vol. 12, no. 3, 1985, pages 139-146; F. GUTZLER et al.: "Gyrase Inhibitors - a new group of antimicrobial agents"

(73) Proprietor: DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.

14-10, Nihonbashi 3-chome  
Chuo-ku,  
Tokyo 103 (JP)

(72) Inventor: Ohta, Genichi  
Daiichi Pharm. Res. Lab.  
16-13, Kitakasai 1-chome  
Edogawa-ku  
Tokyo (JP)

Inventor: Furusawa, Mitsuru  
Daiichi Pharm. Res. Lab.  
16-13, Kitakasai 1-chome  
Edogawa-ku  
Tokyo (JP)

Inventor: Nozaki, Junko  
15-6-306, Shinjuku 6-chome  
Shinjuku-ku  
Tokyo (JP)

Inventor: Iino, Takashi  
Daiichi Pharm. Res. Lab.  
16-13, Kitakasai 1-chome  
Edogawa-ku  
Tokyo (JP)

Note: Within nine months from the publication of the mention of the grant of the European patent, any person may give notice to the European Patent Office of opposition to the European patent granted. Notice of opposition shall be filed in a written reasoned statement. It shall not be deemed to have been filed until the opposition fee has been paid (Art. 99(1) European patent convention).

carboxylic acid (AT-4140),

1-cyclopropyl-6-fluoro-7-(2,6-dimethyl-4-pyridyl)-1,4-dihydro-4-oxo-quinoline-3-carboxylic acid (WIN57273),

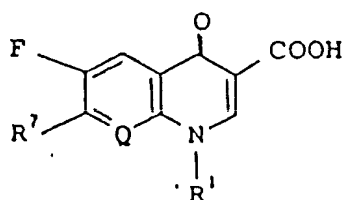
(S)-9-fluoro-2,3-dihydro-3-methyl-10-(4-pyridyl)-7-oxo-7H-pyrido[1,2,3-de][1,4]-benzoxazine-6-carboxylic acid (CP-92121),

or (S)-9-fluoro-2,3-dihydro-3-methyl-10-(2,6-dimethyl-4-pyridyl)-7-oxo-7H-pyrido[1,2,3-de][1,4]-benzoxazine-6-carboxylic acid.

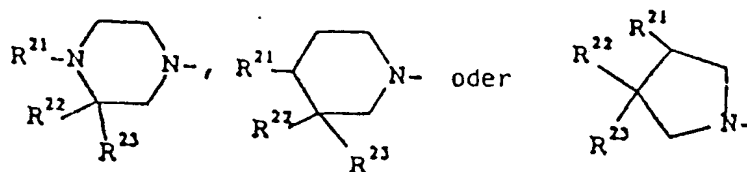
8. The use according to claim 1, wherein said fluorine-containing pyridonecarboxylic acid derivative is 1-epoxymethano-7-fluoro-8-(4-methyl-1-piperazinyl)-5-oxo-5H-thiazolo[3,2-a]quinoline-4-carboxylic acid hydrochloride or 6-fluoro-1-methyl-7-(1-piperazinyl)-4-oxo-4H-[1,3]thiazido[3,2-a]quinoline-3-carboxylic acid.

# Patentansprüche

1. Verwendung eines Fluor enthaltenden Pyridoncarbonsäurederivates der Formel:



worin Q für =N- oder =C(R⁸)- steht, wobei R⁸ für H, F, Cl, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, -OCH₂CH(R⁸¹)-, -SCH₂CH(R⁸¹)- oder -OCH₂N(R⁸¹)- steht, wobei die letzten drei Gruppen mit dem Stickstoffatom des Pyridons verknüpft sind, um einen zusätzlichen Ring zu bilden, in dem R¹ nicht vorkommt und R⁸¹ für H oder C₁-C₄-Alkyl steht; R¹ für C₁-C₈-Alkyl, Cyclopropyl, Halocyclopropyl, Haloethyl, Vinyl, Phenyl oder Halophenyl steht; und R⁷ eine Gruppe der Formeln



darstellt, worin R²¹, R²² und R²³ jeweils unabhängig ein Wasserstoffatom, Halogenatom, eine Amino-, C₁-C₈-Alkyl-, C₁-C₈-Alkoxy- oder Amino-C₁-C₈-Alkyl-Gruppe ist und zwei davon untereinander kombiniert sein können, um einen Spiroring zu bilden; oder eines Salzes oder Hydrates davon zur Herstellung eines pharmazeutischen Mittels für die Behandlung von Infektionen durch humanen Immunschwächevirus und Erkrankungen, hervorgerufen durch humanen Immunschwächevirus.

2. Verwendung gemäß Anspruch 1, worin dieses Fluor enthaltende Pyridoncarbonsäurederivat eine 3-Chinolincarbonsäure ist, wobei R¹ für Cyclopropyl oder Halocyclopropyl und R⁸ für H, F, Cl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy steht.
3. Verwendung gemäß Anspruch 1, wobei dieses Fluor enthaltende Pyridoncarbonsäurederivat eine 1-C₁-C₈-Alkyl-6-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-7-(1-piperazinyl- oder C₁-C₈-Alkyl-substituierte 1-Piperazinyl)-1,8-naphthyridin-3-carbonsäure ist.
4. Verwendung gemäß Anspruch 1, wobei dieses Fluor enthaltende Pyridoncarbonsäurederivat eine 1-Ethyl-6-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-7-(1-piperazinyl oder C₁-C₈-Alkyl-substituierte 1-Piperazinyl)-3-chinolin-